

**(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG**

**(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro**



**(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
13. Januar 2005 (13.01.2005)**

PCT

**(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/003071 A1**

- (51) Internationale Patentklassifikation⁷:** C07C 49/17, C07D 417/06, 493/04
- (21) Internationales Aktenzeichen:** PCT/EP2004/006685
- (22) Internationales Anmeldedatum:**
19. Juni 2004 (19.06.2004)
- (25) Einreichungssprache:** Deutsch
- (26) Veröffentlichungssprache:** Deutsch
- (30) Angaben zur Priorität:**
103 31 004.5 3. Juli 2003 (03.07.2003) DE
- (71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US):** SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Müllerstrasse 178, 13353 Berlin (DE).
- (72) Erfinder; und**
- (75) Erfinder/Anmelder (nur für US):** KLAR, Ulrich [DE/DE]; Isegrimsteig 8a, 13503 Berlin (DE). BUCHMANN, Bernd [DE/DE]; Erdmannstrasse 44, 16540 Hohen Neuendorf (DE). SCHWEDE, Wolfgang [DE/DE]; Maddeburger Strasse 41a, 16548 Glienicker (DE). SKUBALLA, Werner [DE/DE]; Mattersburger Weg 12, 13465 Berlin (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare nationale Schutzrechtsart):** AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO Patent (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)
- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW, ARIPO Patent (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)
- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, die Priorität einer früheren Anmeldung zu beanspruchen (Regel 4.17 Ziffer iii) für den folgenden Bestimmungsstaat US
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US
- Veröffentlicht:**
- mit internationalem Recherchenbericht
- Zur Erklärung der Zweiibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING C1-C15 FRAGMENTS OF EPOTHILONES AND THE DERIVATIVES THEREOF

A1

(54) Bezeichnung: VERFAHREN FÜR DIE HERSTELLUNG VON C1-C15-FRAGMENTEN VON EPOTHILONEN UND DEN DERIVATEN

WO 2005/003071

(57) Abstract: The invention relates to a method for producing C1-C15 fragments of epothilones and the derivatives thereof, whereby a C1-C6 fragment is bonded to a C7-C12 fragment to form a C1-C12 fragment which is then converted with a C13-C15 fragment to form the C1-C15 epothilone intermediate product to be produced. The thus produced C1-C15 epothilone intermediate products can be converted into the intrinsic active ingredients according to known methods. The invention also relates to the corresponding C1-C12 fragments.

(57) Zusammenfassung: Die vorliegende Erfindung beschreibt ein Verfahren für die Herstellung von C1-C15-Fragmenten von Epothilonen und deren Derivaten, bei dem ein C1 - C6-Fragment mit einem C7 - C12-Fragment zu einem C1 - C12-Fragment verknüpft, und dieses dann mit einem C13 - C15-Fragment zu dem herzustellenden C1 - C15-Epothilon-Vorprodukt umgesetzt wird. Die so erhaltenen C1 - C15-Epothilon-Vorprodukte lassen sich nach bekannten Methoden zu den eigentlichen Wirkstoffen umsetzen. Die Erfindung betrifft außerdem die entsprechenden C1 - C12-Fragmente.